

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
14. Juli 2005 (14.07.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/063682 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07C 209/62**,  
227/32, 213/08, 229/02

(21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP2004/013354**

(22) Internationales Anmeldedatum:  
25. November 2004 (25.11.2004)

(25) Einreichungssprache: **Deutsch**

(26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**

(30) Angaben zur Priorität:  
A 2051/2003 19. Dezember 2003 (19.12.2003) **AT**  
A 929/2004 28. Mai 2004 (28.05.2004) **AT**

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): **DSM FINE CHEMICALS AUSTRIA NFG GMBH  
& CO KG** [AT/AT]; St.-Peter-Strasse 25, A-4021 Linz  
(AT).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **WALTHER, Jary**  
[AT/AT]; Seefeld 66, A-4853 Steinbach Am Attersee (AT).  
**DE LANGE, Ben** [NL/NL]; Burgemeester Luytenstraat  
29, NL-6151 GE Munstergeleen (NL). **BROXTERMAN,**  
**Quirinus, Bernardus** [NL/NL]; Gelrestraat 11, NL-6151  
JA Munstergeleen (NL). **PÖCHLAUER, Peter** [AT/AT];  
Am Pöstlingberg 5, A-4040 Linz (AT). **VAN DER SLUIS,**  
**Marcelles** [NL/NL]; Zwanestraat 2-IIIB, NL-9712 CL  
Groningen (NL). **UITERWEERD, Patrick** [NL/NL];  
Bekemaheerd 129, 9737 PS Groningen (NL). **FALK,**  
**Heinz** [AT/AT]; Leonfeldnerstrasse 150, A-4040 Linz  
(AT). **ZUCKERSTÄTTER, Gerhard** [AT/AT]; Risol-  
strasse 496, A-5412 Puch bei Salzburg (AT).

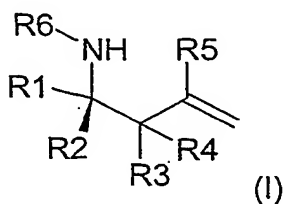
(74) Anwalt: **LINDINGER, Ingrid**; DSM Fine Chemicals  
Austria Nfg GmbH & Co KG, St.-Peter-Strasse 25, A-4021  
Linz (AT).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): **AE, AG, AL,**

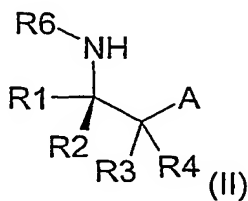
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: **IMPROVED METHOD FOR PRODUCING CHIRAL OR ENANTIOMER-ENRICHED BETA-AMINO ACIDS,  
-ALDEHYDES, -KETONES AND GAMMA-AMINO ALCOHOLS**

(54) Bezeichnung: **VERBESSERTES VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON CHIRALEN ODER ENANTIOMERENAN-  
GEREICHERTEN BETA-AMINOSÄUREN -ALDEHYDEN, - KETONEN UND GAMMA-AMINOALKOHOLEN**



(57) Abstract: The invention relates to an improved method for producing chiral or enantiomer-enriched beta amino acids, -aldehydes, -ketones and gamma-amino alcohols, during which an allyl amine of formula (I), in which: R1 represents an alkyl radical, a cycloalkyl radical, an alkyl radical, a heterocycle radical or a condensed or bridged ring system; R2, R3, R4 and R5, independent of one another, can represent H or an alkyl radical, a cyclo alkyl radical, an aryl radical, a heterocycle radical or a condensed or bridged ring system or radicals R1, R2, R3 and R4, together, form ring systems that can optionally contain one or more heteroatoms, whereby radicals R1, R2, R3, R4 and R5 can be substituted once or a number of times, and; R6 represents H or an N-protective group, is transformed; a) by ozonolysis in a solvent and; b) subsequent decomposition of the peroxide-containing solution by means of an oxidizing agent or reductive reprocessing, into the corresponding amino compound of formula (II), in which R1, R2, R3, R4 and R6 are defined as above, and; A, according to the reprocessing, represents a radical of formula COOH, -C(OH)R5 or -C(O)R5, whereby R5 is defined as above.



(57) Zusammenfassung: Verbessertes Verfahren zur Herstellung von chiralen oder enantiomerenangereicherten betaAminosäuren -aldehyden, -ketonen und gamma-Aminoalkoholen, bei welchem ein Allylamin der Formel (I), in der R1 einen Alkylrest, einen Cycloalkylrest, einen Arylrest, einen Heterocyclusrest oder ein kondensiertes oder überbrücktes Ringsystem bedeutet, R2, R3, R4 und R5 unabhängig voneinander H oder einen Alkylrest, einen Cycloalkylrest, einen Arylrest, einen Heterocyclusrest oder ein kondensiertes oder überbrücktes Ringsystem

bedeuten können, oder die Reste R1, R2, R3 und R4 untereinander Ringsysteme bilden können, die gegebenenfalls ein oder mehrere Heteroatome enthalten können, wobei die Reste R1, R2, R3, R4 und R5 gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können und R6 H oder eine N-Schutzgruppe ist, a) durch Ozonolyse in einem Lösungsmittel und b) anschließender Zersetzung der peroxidhaltigen Lösung mittels eines Oxidationsmittel oder reduktiver Aufarbeitung in die entsprechende Aminoverbindung der Formel (II), in der R1, R2, R3, R4 und R6 wie oben definiert sind, und A in Abhängigkeit von der Aufarbeitung für einen Rest der Formel -COOH, C(OH)R5 oder -C(O)R5 steht, wobei R5 wie oben definiert ist, überführt wird.

WO 2005/063682 A1



AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.